

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESEN (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



54063

030311



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
3. Juni 2004 (03.06.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2004/046150 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 487/04,  
A01N 43/90 // (C07D 487/04, 249/00, 239/00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/012774

(22) Internationales Anmeldedatum:  
14. November 2003 (14.11.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 53 592.2 15. November 2002 (15.11.2002) DE  
102 57 394.8 6. Dezember 2002 (06.12.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): BASF AKTIENGESellschaft [DE/DE];  
67056 Ludwigshafen (DE).

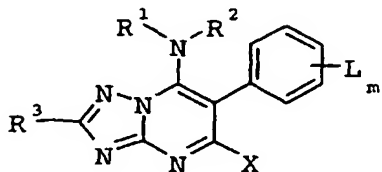
(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO,  
Jordi [DE/DE]; Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach  
(DE). BLETNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wag-  
ner-Str. 48, 68165 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd  
[DE/DE]; Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal (DE).  
GEWEHR, Marko [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288  
Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilios [DE/DE];  
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).  
GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hoehnhausen 18, 67157  
Wachenheim (DE). GYPSEER, Andreas [DE/DE]; B 4  
4, 68159 Mannheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim  
[DE/DE]; Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen (DE).  
SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr. 1, 67308  
Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lin-  
denweg 4, 67258 Hessheim (DE). SCHWÖGLER, Anja  
[DE/DE]; Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 2-SUBSTITUTED TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS AND INTERMEDIATE PRODUCTS FOR THE PRO-  
DUCTION THEREOF, THE USE OF THE SAME FOR CONTROLLING PATHOGENIC FUNGI, AND AGENTS CONTAINING  
SAID COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: 2-SUBSTITUIERTE TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN UND ZWISCHENPRODUKTE ZU IHRE  
HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE  
MITTEL



(I)

(57) Abstract: The invention relates to 2-substituted  
triazolopyrimidines of formula (I) wherein the substituents  
have the following designations: L represents halogen, cyano,  
nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, halogenalkyl, halogenalkenyl,  
alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy, halogenalkoxy, -C(=O)-A  
or S(=O)<sub>p</sub>A'; A and A' have the designations cited in the  
description; p represents 0, 1 or 2; m represents 0 or 1, 2,  
3, 4 or 5; X represents cyano, alkyl, halogenalkyl, alkoxy

or halogenalkoxy; R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> represent hydrogen, alkyl, halogenalkyl, cycloalkyl, halogenalkenyl, cycloalkenyl, alkynyl, halogenalkynyl or cycloalkynyl, phenyl, naphthyl, or a five to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle containing between one and four heteroatoms from the group O, N or S - R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> can also form a five-membered or six-membered ring, together with the nitrogen atom to which they are bound, said ring being broken by an atom from the groups O, N and S, and R<sup>1</sup> and/or R<sup>2</sup> can be substituted according to the description; and R<sup>3</sup> represents cyano, hydroxy, alkoxy, alkenyloxy, halogenalkoxy, halogenalkenyloxy, NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> or S(O)<sub>n</sub>R<sup>31</sup>, wherein n and R<sup>31</sup> have the designations cited in the description. The invention also relates to methods and intermediate products for producing said compounds, to agents containing the same, and to the use thereof for controlling plant pathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung: 2-Substituierte Triazolopyrimidine der Formel (I) in die Substituenten folgende Bedeutung haben: L Ha-  
logen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Halogenalkoxy,  
-C(=O)-A oder S(=O)<sub>p</sub>A'; A und A' gemäß der Beschreibung definiert sind; p 0, 1 oder 2; m 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5 bedeuten;  
X Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy; R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl-  
alkyl, Alkenyl, Alkadienyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein  
fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus  
der Gruppe O, N oder S, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder  
sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein, wobei R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> gemäß der  
Beschreibung substituiert sein können; und R<sup>3</sup> Cyano, Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>  
oder S(O)<sub>n</sub>R<sup>31</sup>, wobei n und R<sup>31</sup> gemäß der Beschreibung definiert sind; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser  
Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

WO 2004/046150 A1

N1



AMMERMANN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Str.2, 64646 Heppenheim (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Luftschiffing 22c, 68782 Brühl (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CQ, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IL, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NI, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

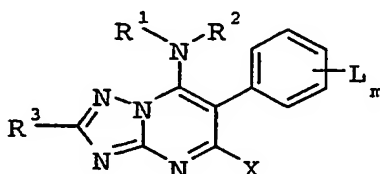
2-Substituierte Triazolopyrimidine, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

5

## Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 2-substituierte Triazolopyrimidine der Formel I,

10



I

15

in die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- L unabhängig voneinander Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, -C(=O)-A oder S(=O)<sub>p</sub>A';
- A Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino oder Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)amino;
- A' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;
- p 0, 1 oder 2;
- m 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5;
- X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy;
- R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenocycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>-Alkadienyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

45

5 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette verbunden sein können;

10 wobei R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> substituiert sein kann:

15 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliederiger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

20 wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>b</sup> tragen können:

25 R<sup>b</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinygruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

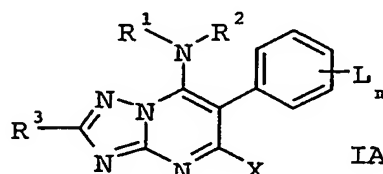
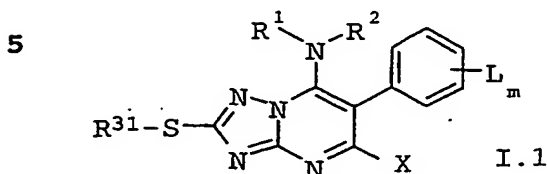
40 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

45 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vor-

zugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können; und

- 5  $R^3$  Cyano, Hydroxy,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -Alkenyloxy,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenalkenyloxy,  $NR^1R^2$  oder  $S(=O)_nR^{31}$ ;
- 10  $n$  0, 1 oder 2;
- $R^{31}$  Wasserstoff, Hydroxy,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl oder  $-C(=O)-A$ .
- 15 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.
- 20 Aus EP-A 71 792 und EP-A 550 113 sind 6-Phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. In 2-Stellung substituierte Triazolopyrimidine sind aus EP-A 71 792, EP-A 141 317, WO 02/88126 und WO 02/88127 bekannt. Die in den genannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignet.
- 25 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.
- 30 Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Desweiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen unter Verwendung der
- 35 Verbindungen I gefunden.
- Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften durch den Substituenten in der 2-Position, bzw. der 5-Position.
- 40 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen pflanzenpathogene Schadpilze auf.
- 45 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden.

Ein bevorzugter Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen der Formel I.1, in der die Variablen und der Index wie für Formel I definiert sind.



10

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand sind Verbindungen der Formel IA, in der R<sup>3</sup> für Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyloxy oder NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> bedeutet und L<sub>m</sub>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und X wie für Formel I definiert sind.

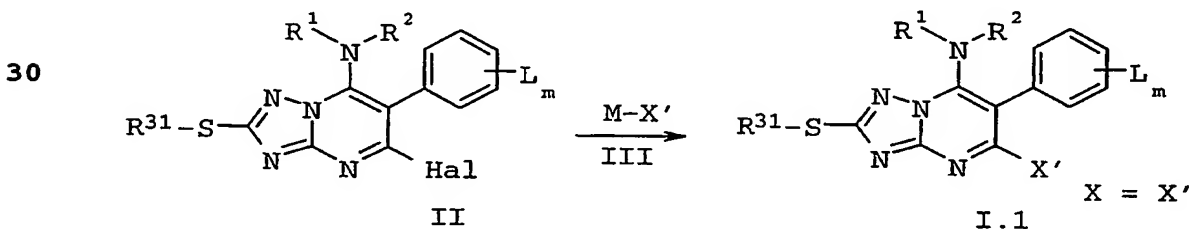
15

Vorteilhaft werden Thioverbindungen der Formel I.1, in denen X für Cyano, Alkoxy oder Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von Halogenverbindungen der Formel II, in der Hal bevorzugt für Chlor steht, mit Verbindungen M-X' (Formel III) erhalten.

20

Verbindungen III stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel III hat

25 geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



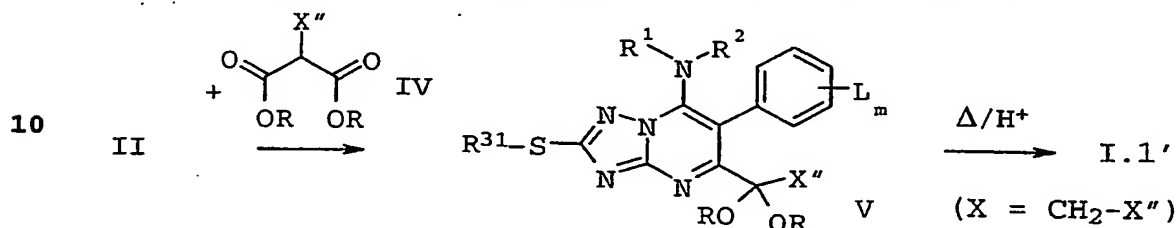
35 Üblicherweise liegt dabei die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether  
40 und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichloromethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

Thioalkylverbindungen der Formel II sind an sich aus WO 02/88127  
45 bekannt.

Verbindungen der Formel 1.1, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht (Formel 1.1'), können aus Verbindungen II, in der Hal insbesondere Chlor bedeutet, und Malonaten der Formel IV hergestellt werden. In Formel IV bedeuten X" Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R

5 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel V umgesetzt und zu Verbindungen I.1' decarboxyliert [vgl. US 5,994,360].



Die Malonate IV sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc.,  
15 Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die anschließende Verseifung des Esters V erfolgt unter allgemein  
20 üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen V vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I.1' bereits ganz oder teilweise erfolgen.

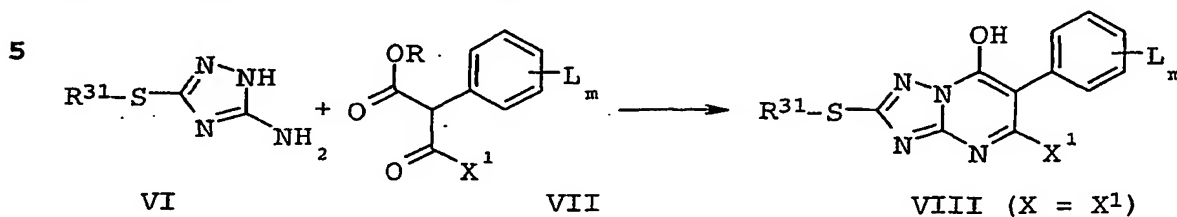
25

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

30 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe  
35 wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol,  
40 Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

45

Verbindungen der Formel I.1, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, können vorteilhaft auch durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:



**10**

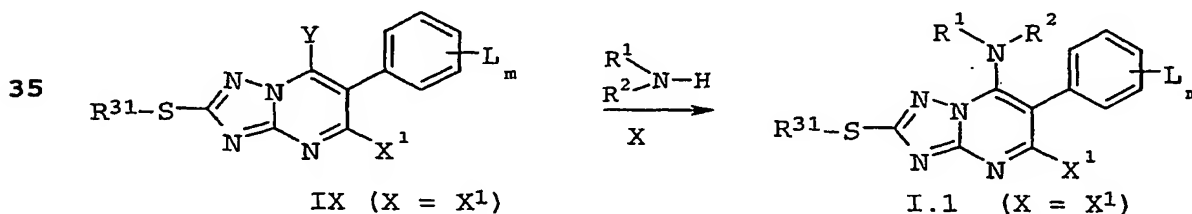
Ausgehend von den Diketonen VII werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VIII erhalten. In Formel VII steht X<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigester (VII mit X<sup>1</sup>=CH<sub>3</sub>) werden

15 die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen VII erfolgt vorteilhaft unter den in EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

20 Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln zu den 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel IX umgesetzt. Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt.

25 Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise von 80 bis 125°C [vgl. EP-A 770 615].

30 Die 5-Alkyl-7-halogen-6-phenyltriazolopyrimidine der Formel IX werden mit Aminen der Formel X, in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> wie in Formel I definiert sind, zu Verbindungen der Formel I.1 weiter umgesetzt.



40 Diese Umsetzung wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichloromethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispiels-  
45 weise Toluol [vgl. WO 98/46608].

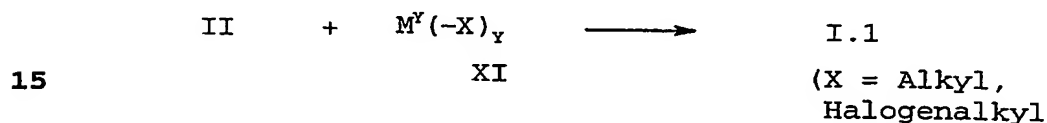


Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Amine, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel X kann als Base dienen.

5

Verbindungen der Formel I.1, in der X für Alkyl oder Halogenalkyl steht, können auch durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel II mit metallorganischen Reagenzien der Formel XI, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, erhalten

10 werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.

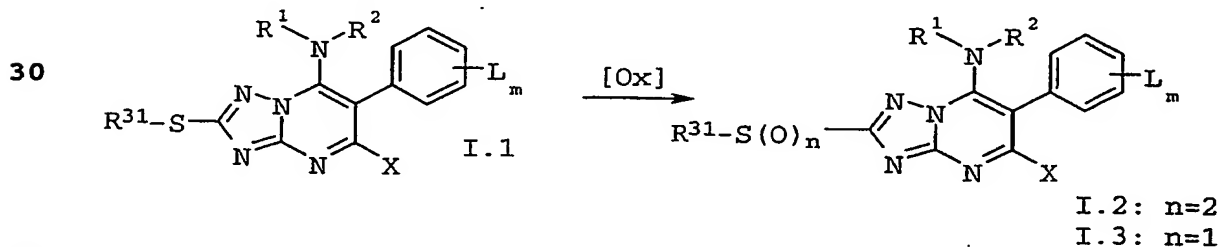


15

In Formel XI steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

25

Verbindungen der Formel I, in der R<sup>3</sup> für S(O)<sub>1-2</sub> R<sup>31</sup> steht, werden durch Oxidation der entsprechenden Thioverbindungen I.1 erhalten.



30

35

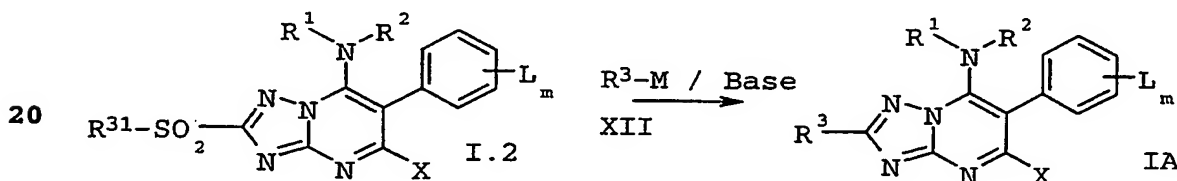
Die Oxidation der Thiolate I.1 zu Sulfonen I.2, bzw. Sulfoxiden I.3 erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -40°C bis 60°C, vorzugsweise -40°C bis 40°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. WO 94/14761; Synth. Commun., Bd. 16, S. 233ff. (1986)].

40 Als Oxidationsmittel kommen beispielsweise anorganische Peroxide, wie Wasserstoffperoxid oder Peroxocarbonsäuren, wie Peressigsäure oder Perbenzoesäuren, insbesondere meta-Chlorperbenzoesäure, in Betracht. Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute  
45 vorteilhaft sein, das Oxidationsmittel in einem Überschuß bezogen auf I.1 einzusetzen.

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $S-R^{31}$  steht (Formel I.1), sind auch wertvolle Zwischenprodukte zur Herstellung weiterer Verbindungen I.

- 5 Aus praktischen Gründen werden zur Herstellung von Verbindungen IA bevorzugt Zwischenprodukte verwendet, in denen  $R^{31}$  für Methyl steht.

- Verbindungen der Formel I, in der  $R^3$  nicht  $S(O)_nR^{31}$  bedeutet, werden vorteilhaft durch Umsetzung von Sulfonen der Formel I.2 unter basischen Bedingungen mit Verbindungen der Formel XII erhalten. Verbindungen XII stellen je nach Ausgestaltung der Gruppe  $R^3$  Cyanide, Hydroxide, Alkoholate oder Amine dar. Das Kation M in Formel XII hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



- Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von  $-20^\circ\text{C}$  bis  $120^\circ\text{C}$ , vorzugsweise  $0^\circ\text{C}$  bis  $25^\circ\text{C}$ , in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. Heteroat. Chem. S.313 (2000)].

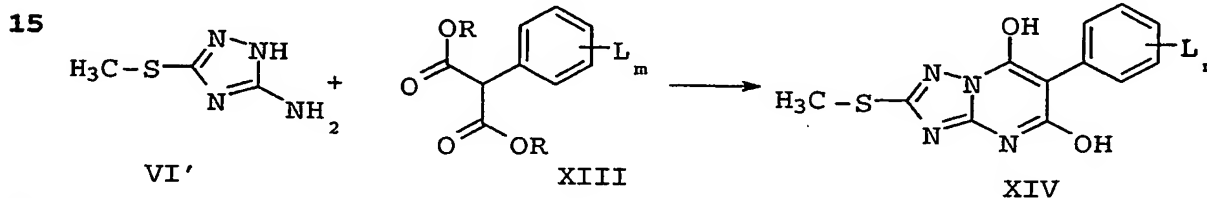
- Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile, Ketone, Alkohole sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Dimethylsulfoxid, Dioxan und Benzol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt wird Natriumhydrid. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, XII in einem Überschuß bezogen auf I.2 einzusetzen.

- 5 Ein besonders vorteilhafter Zugang zu den Zwischenprodukten der Formel II, in denen R<sup>31</sup> Methyl bedeutet, besteht in den folgenden Routen:

Ausgehend von 3-Thiomethyl-5-aminotriazol der Formel VI' werden  
10 mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel XIII, in der R für Alkyl, bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, die Dihydroxytriazolopyrimidine XIV dargestellt.



- 20 Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den  
25 aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

- Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol,  
30 halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der ge-  
35 nannten Lösungsmittel verwendet werden.

- Als Basen kommen insbesondere organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin,  
40 substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber  
45 auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Malonat XIII in einem Überschuß bezogen auf das Triazol VI einzusetzen.

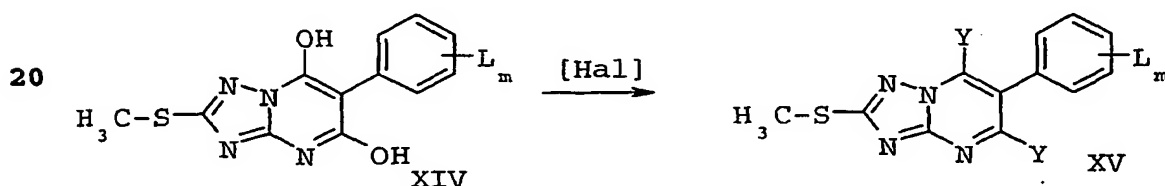
5

3-Thio-5-aminotriazol der Formel VI' ist kommerziell erhältlich. Phenylmalonate der Formel XIII werden vorteilhaft aus der Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370

10 (1981); EP-A 10 02 788].

Die Dihydroxytriazaolopyrimidine der Formel XIV werden unter den aus WO 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel XV überführt. Als Halogenierungsmittel [Hal] wird vor-

15 teilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxybromid oder Phosphoroxychlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.

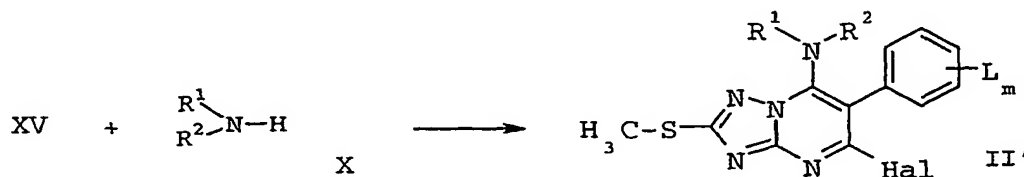


Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt

25 bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].

Dihalogenpyrimidine der Formel XV werden mit Aminen der Formel X zu Verbindungen der Formel II' weiter umgesetzt.

30



35 Verbindungen der Formel II' sind an sich aus WO 02/88127 bekannt.

Sofern R<sup>1</sup> oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen beinhalten ist für optisch aktive Amine der Formel X die (S)-Konfiguration bevorzugt.

40

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräun-

45 licher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe

erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

5 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

10 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu be-

15 kämpfenden Schadpilz erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

20

**Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;

**Alkyl:** gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B.

25 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl,

30 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

35 **Halogenalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl,

40 Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl,

45 Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

- Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl; 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

- Alkadienyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in beliebiger Position;

- Halogenalkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

- Alkynyl:** geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl,

1-Methyl-2-pentynyl, 1-Methyl-3-pentynyl, 1-Methyl-4-pentynyl, 2-Methyl-3-pentynyl, 2-Methyl-4-pentynyl, 3-Methyl-1-pentynyl, 3-Methyl-4-pentynyl, 4-Methyl-1-pentynyl, 4-Methyl-2-pentynyl, 1,1-Dimethyl-2-butyryl, 1,1-Dimethyl-3-butyryl, 1,2-Dimethyl-3-butyryl, 2,2-Dimethyl-3-butyryl, 3,3-Dimethyl-1-butyryl, 1-Ethyl-2-butyryl, 1-Ethyl-3-butyryl, 2-Ethyl-3-butyryl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propynyl;

**Cycloalkyl:** mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

**Oxyalkylenoxy:** divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;

**fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:**

- **5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl**, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranlyl, 3-Tetrahydrofuranlyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranlyl, 4-Tetrahydropyranlyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
- **5-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;

- **6-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;

**Alkylen**: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH<sub>2</sub>-Gruppen, z.B. CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

10

**Oxyalkylen**: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

- 15 Oxyalkylenoxy**: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O.

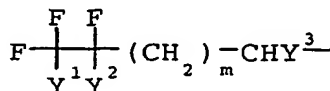
- In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

- Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L<sub>n</sub>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und X der Formel I.

- Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht.

- 35** Verbindungen I sind besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe B steht



B

40

worin

- Y<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,  
 Y<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder  
**45** Y<sup>1</sup> und Y<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;  
 m is 0 oder 1; und  
 Y<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten.



## 15

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl steht, welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

- 5 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

10

Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind die (S)-Isomere bevorzugt.

- 15 Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinyllgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind die (R)-Isomere bevorzugt.

- Weiterhin werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom  
20 aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette verbunden sein können.

25

- Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der ggf. eine Doppelbindung aufweisen kann und wie voranstehend beschrieben substituiert sein  
30 kann.

- Insbesondere werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidinyll-, Morpholinyl- oder Thiomorpholinylring,  
35 insbesondere einen Piperidinyllring bilden, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiert ist, insbesondere einen durch 4-Methyl substituierten Piperidinyllring bilden.

- 40 Weiterhin besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrrolidinring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, insbesondere durch 2-Methyl substituiert ist.

45

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R<sup>3</sup> für Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> steht.

Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen mindestens eine Gruppe L orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst steht; insbesondere solche, in denen m den Wert 1, 2 oder 3 aufweist.

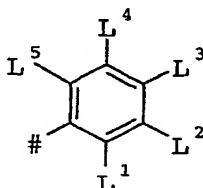
5

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen  $L_m$  Halogen, Methyl, Ethyl,  $C_1$ -Halogenalkyl, Methoxy oder  $-C(=O)-A$ , worin A Wasserstoff, Hydroxy,  $C_1-C_4$ -Alkoxy,  $C_1-C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1-C_2$ -Alkylamino oder Di- $(C_1-C_2$ -Alkyl)amino bedeutet.

10

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen die durch  $L_m$  substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A

15



A

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und

- 20  $L^1$  Fluor, Chlor,  $CH_3$  oder  $CF_3$ ;  
 $L^2, L^4$  unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;  
 $L^3$  Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano,  $CH_3$ ,  $SCH_3$ ,  $SO_2CH_3$ ,  $OCH_3$  oder  $COOCH_3$ ; und  
 25  $L^5$  Wasserstoff, Fluor oder  $CH_3$  bedeuten.

- Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen  $L_m$  für eine der folgenden Substituentenkombinationen steht: 2-Fluor-6-chlor, 2,6-Difluor, 2,6-Dichlor, 2-Fluor-6-methyl, 2,4,6-Trifluor,  
 30 2,6-Difluor-4-methoxy, Pentafluor, 2-Methyl-4-fluor, 2-Trifluor-methyl, 2-Methoxy-6-fluor, 2-Chlor, 2-Fluor, 2,4-Difluor, 2-Fluor-4-chlor, 2-Chlor-4-fluor, 2,3-Difluor, 2,5-Difluor, 2,3,4-Trifluor, 2-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Methyl-4-chlor, 2-Fluor-4-methyl, 2,6-Dimethyl, 2,4,6-Trimethyl,  
 35 2,6-Difluor-4-methyl, 2-Trifluormethyl-4-fluor, 2-Trifluor-methyl-5-fluor oder 2-Trifluormethyl-5-chlor.

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen X  $C_1-C_4$ -Alkyl, insbesondere Methyl bedeutet.

40

- Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in  
 45 der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

## Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-6-chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-6-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxy,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  Pentafluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl-4-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

## Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Meth-

oxy-6-fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 11

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 12

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 13

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 14

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor-4-chlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor-4-fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 16

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,3-Difluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 17

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 18

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,3,4-Trifluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 19

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 20

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 21

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 22

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 23

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 24

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl-4-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und

45

R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 29

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 Tabelle 30

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-chlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 31

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 32

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 33

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 34

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 35

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,4,6-Trifluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 36

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 37

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup>

Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 38

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl-4-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 39

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 40

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methoxy-6-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 41

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 42

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 43

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 44

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 45

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 46

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 47

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,5-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 48

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 49

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 50

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 51

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 52

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 53

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 54

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 55

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

## Tabelle 56

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Di-



fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 57

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 Tabelle 58

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 59

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 60

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 61

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 62

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 63

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 64

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45 Tabelle 65

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,4,6-Trifluor,

R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 66

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 67

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 68

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 69

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 70

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methoxy-6-fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 71

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 72

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 73

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45 Tabelle 74

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor-4-chlor,

R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 75

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor-4-fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 76

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,3-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 77

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 78

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,3,4-Trifluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 79

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 80

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,4-Dimethyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 81

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl-4-chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 82

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 83

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Dimethyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 84

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Dimethylamino bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 85

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Di-fluor-4-cyano,  $R^3$  Dimethylamino bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

## Tabelle 86

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Di-fluor-4-methyl,  $R^3$  Dimethylamino bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 87

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Dimethylamino bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 88

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl-4-fluor,  $R^3$  Dimethylamino bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## 30 Tabelle 89

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl-5-fluor,  $R^3$  Dimethylamino bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 90

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl-5-chlor,  $R^3$  Dimethylamino bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 91

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-6-chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

## Tabelle 92

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 93

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 94

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-6-methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 95

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 96

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxy,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

25 spricht

## Tabelle 97

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  Pentafluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 98

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl-4-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 99

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 100

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methoxy-6-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

## Tabelle 101

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 102

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 103

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4-Difluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 104

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 105

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 106

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3-Difluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 107

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,5-Difluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 108

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 109

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

## Tabelle 110

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4-Dimethyl,  $R^3$

Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 111

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 112

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 113

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 114

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 115

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 116

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 117

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

40 entspricht

Tabelle 118

- Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl-4-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 45

Tabelle 119

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl-5-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A 5 entspricht

Tabelle 120

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Trifluormethyl-5-chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A 10 entspricht

Tabelle A

	No.	$R^1$	$R^2$
15	A-1	H	H
	A-2	$CH_2CH_3$	H
	A-3	$CH_2CH_3$	$CH_3$
	A-4	$CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
20	A-5	$CH_2CF_3$	H
	A-6	$CH_2CF_3$	$CH_3$
	A-7	$CH_2CF_3$	$CH_2CH_3$
	A-8	$CH_2CCl_3$	H
25	A-9	$CH_2CCl_3$	$CH_3$
	A-10	$CH_2CCl_3$	$CH_2CH_3$
	A-11	$CH_2CH_2CH_3$	H
	A-12	$CH_2CH_2CH_3$	$CH_3$
30	A-13	$CH_2CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-14	$CH_2CH_2CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$
	A-15	$CH(CH_3)_2$	H
	A-16	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$
	A-17	$CH(CH_3)_2$	$CH_2CH_3$
35	A-18	$(\pm) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H
	A-19	$(\pm) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_3$
	A-20	$(\pm) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-21	$(S) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H
40	A-22	$(S) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_3$
	A-23	$(S) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-24	$(R) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H
	A-25	$(R) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_3$
45	A-26	$(R) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-27	$(\pm) CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	H
	A-28	$(\pm) CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	$CH_3$



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-29	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-30	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
5 A-31	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-32	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-33	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-34	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
10 A-35	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-36	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-37	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-38	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-39	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
15 A-40	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-41	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-42	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-43	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20 A-44	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-45	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-46	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-47	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
25 A-48	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-49	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-50	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-51	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
30 A-52	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-53	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-54	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-55	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-56	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
35 A-57	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-58	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-59	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-60	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
40 A-61	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-62	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-63	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-64	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
45 A-65	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-66	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-67	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-68	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-69	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
5 A-70	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-71	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-72	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H
A-73	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
10 A-74	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-75	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	H
A-76	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-77	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-78	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
15 A-79	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-80	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-81	Cyclopentyl	H
A-82	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
20 A-83	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-84	Cyclohexyl	H
A-85	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-86	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
25 A-87	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-88	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	
A-89	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-90	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-91	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CHFCH <sub>2</sub> -	
30 A-92	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-93	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-94	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-95	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
35 A-96	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
A-97	-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-98	-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-99	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	

40

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und

45 *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen 5 wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 10 • *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- 15 • *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- 20 • *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- 25 • *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- 30 • *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schädlingen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

35

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach 40 der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

45

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

- 5 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

- Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich  
10 die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

- 15 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine  
20 feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

- Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgier-  
25 mitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Me-  
30 thanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,  
35
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Ton-  
erden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie  
nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethy-  
40 len-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methyl-cellulose.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-,  
45 Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate,

Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykoether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Form-  
5 aldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Tristerylphenylpolyglykoether, Alkyl-arylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether,  
10 ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpoly-glykoetheracetat, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen,  
15 Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naph-  
20 thaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

25 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogen-  
30 granulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunst-  
35 stoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nussschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

40 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

- A Wasserlösliche Konzentrate (SL)  
5 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.
- 10 B Dispergierbare Konzentrate (DC)  
20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.
- 15 C Emulgierbare Konzentrate (EC)  
15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.
- 20 D Emulsionen (EW, EO)  
40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.
- 25 E Suspensionen (SC, OD)  
20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.
- 30 F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)  
40 50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.
- 45

- G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)  
75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

2. Produkte für die Direktapplikation

- 10 H Stäube (DP)  
5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.
- 15 I Granulate (GR, FG, GG, MG)  
0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.
- 20
- J ULV- Lösungen (UL)  
10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.
- 25

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder

- 30 Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubmitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.
- 35

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von

- 40 Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder
- 45 Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

5

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

10

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel werden

15 üblicherweise zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der

20 z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

25

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

30 • Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,

- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph

35 • Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,

- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,

40 • Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,

45

- Dicarboximide wie Iprodion, Myclobenzol, Procymidon, Vinclozolin,



- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb, ..
- Heterocyklische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.
- Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften können unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt werden.

Beispiel 1: Herstellung von 5-Cyano-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-2-thiomethyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin

- 5 Eine Mischung von 0,1 mol 5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-2-thiomethyl-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pyrimidin (WO 02/088127) und 0,25 mol Tetraethylammoniumcyanid 750 ml Dimethylformamid (DMF) wurde etwa 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Nach Zusatz von Wasser, Extraktion mit Me-
- 10 thyl-tert. Butylether (MTBE) und anschließender Phasentrennung wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen und getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurde der Rückstand an Kieselgel chromatographiert. Man erhielt 4,21 g der Titelverbindung vom Fp. 212 °C.

15

Beispiel 2: Herstellung von 5-Methoxy-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-2-thiomethyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin

- 20 Eine Lösung von 65 mmol 5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-2-thiomethyl-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pyrimidin (WO 02/088127) in 400 ml wasserfr. Methanol wurde mit einer 30%igen Natriummethanolat-Lösung (71,5 mmol) bei etwa 20 bis 25°C versetzt, dann etwa 16 Std. bei dieser
- 25 Temperatur gerührt. Methanol wurde abdestilliert und der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen. Die organische Phase wurde mit Wasser gewaschen und nach Trocknung vom Lösungsmittel befreit. Nach Chromatographie an Kieselgel erhielt man aus dem Rückstand 4,02 g der Titelverbindung vom Fp. 185 °C.

30

Beispiel 3: Herstellung von 5-Methyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-2-thiomethyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin

- 35 Eine Mischung von 20 ml Diethylmalonat und 0,27 g Natriumhydrid als 50%ige Dispersion in Mineralöl in 50 ml Acetonitril wurde bei 20 bis 25°C etwa zwei Std. gerührt, dann wurden 4,71 mmol 5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(4-methyl-
- 40 piperidin-1-yl)-2-thiomethyl-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pyrimidin (WO 02/088127) zugegeben und die Mischung etwa 20 Std. bei etwa 60°C gerührt. Nach Zusatz von 50 ml wässr. Ammoniumchlorid-Lösung wurde mit verd. HCl-Lösung angesäuert. Die Reaktionsmischung wurde mit Methyl-tert. Butylether (MTBE) extrahiert, nach Phasentrennung wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen und ge-
- 45 trocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurde der Rückstand an Kieselgel chromatographiert.

Das erhaltene Produkt wurde in verd. HCl-Lösung aufgenommen und die Lösung etwa 24 Std. bei 80°C gehalten. Nach Abkühlen wurde mit wässr. NaOH-Lösung ein pH-Wert von 5 eingestellt und die Lösung mit Methyl-tert. Butylether (MTBE) extrahiert. Die vereinigten 5 organischen Phasen wurden getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Nach Chromatographie an Kieselgel erhielt man 0,73 g der Titelverbindung vom Fp. 149 °C.

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

10

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch folgenden Versuch zeigen:

Die Wirkstoffe wurden als Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% 15 Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

20 Anwendungsbeispiel - Wirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani* bei protektiver Anwendung

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. 25 Pierre" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von  $0,17 \times 10^6$  Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die 30 Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

35

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm des Wirkstoffs aus Beispiel 3 behandelten Pflanzen 20 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

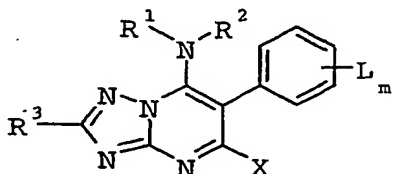
40

45

## Patentansprüche

## 1. 2-Substituierte Triazolopyrimidine der Formel I

5



I

10 in die Substituenten folgende Bedeutung haben:

15 L unabhängig voneinander Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, -C(=O)-A oder S(=O)<sub>p</sub>A';

20 A Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino oder Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)amino;

A' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;

p 0, 1 oder 2;

25

m 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5;

X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy;

30

35 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>-Alkadienyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

40

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen

45

kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette verbunden sein können;

wobei R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> substituiert sein kann:

R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>b</sup> tragen können:

R<sup>b</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl-

oder Haloalkylgruppen substituiert sein können; und

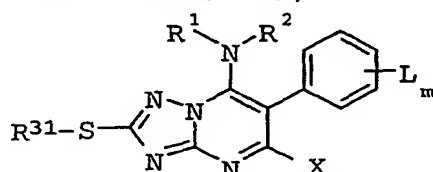
5  $R^3$  Cyano, Hydroxy,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -Alkenyloxy,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenalkenyloxy,  $NR^1R^2$  oder  $S(O)_nR^{31}$ ;

$n$  0, 1 oder 2;

10  $R^{31}$  Wasserstoff, Hydroxy,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl oder  $-C(=O)-A$ .

2. Verbindungen der Formel I.1,

15

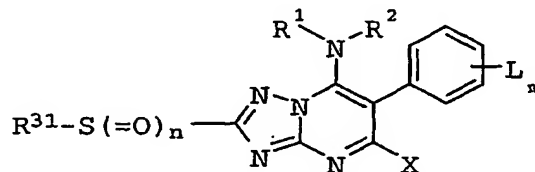


I.1

20 in der die Variablen und der Index  $m$  wie für Formel I gemäß Anspruch 1 definiert sind.

3. Verbindungen der Formel I.2 und I.3,

25

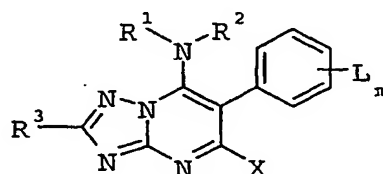


I.2:  $n=2$   
I.3:  $n=1$

30 in der die Variablen und der Index  $m$  wie für Formel I gemäß Anspruch 1 definiert sind.

4. Verbindungen der Formel IA,

35



IA

40 in der

$R^3$  Cyano, Hydroxy,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -Alkenyloxy,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenalkenyloxy oder  $NR^1R^2$ ;

und  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$  und  $L_m$  wie für Formel I gemäß Anspruch 1 definiert sind.

45

5. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, in der  $R^1$  und  $R^2$  folgende Bedeutung haben:

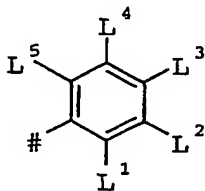
5  $R^1$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogencycloalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkinyl; und

$R^2$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl; oder

10  $R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der einen oder zwei Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl und  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl tragen kann;

- 15 6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der die durch  $L_m$  substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A

20



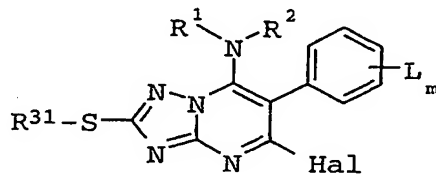
A

- 25 steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und

$L^1$  Fluor, Chlor,  $CH_3$  oder  $CF_3$ ;  
 $L^2, L^4$  unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;  
 30  $L^3$  Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano,  $CH_3$ ,  $SCH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $SO_2CH_3$  oder  $COOCH_3$  und  
 $L^5$  Wasserstoff, Fluor oder  $CH_3$  bedeuten.

- 35 7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I.1 gemäß Anspruch 2, in der X für Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von Verbindungen der Formel II

40



II

in der Hal für ein Halogenatom steht, mit Verbindungen M-X'

45

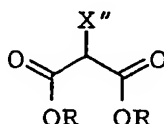
M-X'

III

wobei M in Formel III für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetall und X' für Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy steht.

- 5 8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I.1 gemäß Anspruch 2, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, durch Umsetzung von Verbindungen II gemäß Anspruch 7 und Malonaten der Formel IV,

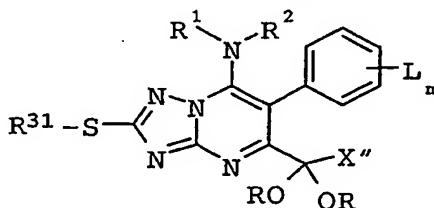
10



IV

in der X'' Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel V

15



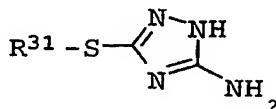
V

20

und Verseifung von V und Decarboxylierung.

9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I.1 gemäß Anspruch 2, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von Triazolen der Formel VI

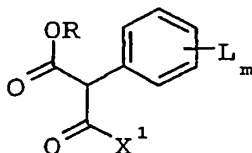
25



VI

30

mit Dicarbonylverbindungen der Formel VII,

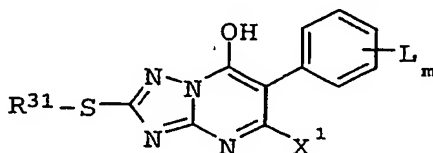


VII

35

in der R und X<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl stehen zu Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel VIII,

40



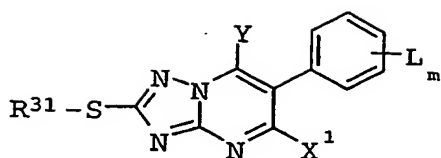
VIII

Halogenierung von VIII zu Verbindungen der Formel IX

45



47

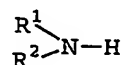


IX

5

in der Y für Halogen, insbesondere Chlor oder Brom steht und Umsetzung von IX mit Aminen der Formel X,

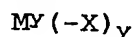
10



X

in der R¹ und R² die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben.

10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I.1 gemäß Anspruch 2, in der X für C₁-C₄-Alkyl steht, durch Umsetzung von Halogenverbindungen der Formel II gemäß Anspruch 7 mit metallorganischen Reagenzien der Formel XI



XI

20

in der M für B, Zn oder Sn steht, X C₁-C₄-Alkyl bedeutet und y der Wertigkeit von M entspricht.

11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I.2 gemäß Anspruch 3 durch Oxidation von Verbindungen der Formel I.1 gemäß Anspruch 2.

12. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel IA gemäß Anspruch 4, durch Umsetzung von Verbindungen der Formel I.2 gemäß Anspruch 3, in der n = 2 ist, mit Verbindungen der Formel XII



XII

- in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und R³ die für Formel IA gegebene Bedeutung hat, unter basischen Bedingungen.

13. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

14. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

PCT/EP 02/12774

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D487/04 A01N43/90 //(C07D487/04,249:00,239:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 02/088127 A (BAYER) 7 November 2002 (2002-11-07) cited in the application claims 1,3	1,13
A	WO 02/088126 A (BAYER) 7 November 2002 (2002-11-07) cited in the application claims 1,3	1,13

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

26 April 2004

Date of mailing of the international search report

04/05/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Alfaro Faus, I

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

PCT/EP 03/12774

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
WO 02088127	A	07-11-2002	DE	10121102 A1	07-11-2002
			WO	02088127 A2	07-11-2002
			EP	1392695 A2	03-03-2004
WO 02088126	A	07-11-2002	DE	10121162 A1	31-10-2002
			WO	02088126 A1	07-11-2002
			EP	1392693 A1	03-03-2004

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

PCT/EP 12774

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D487/04 A01N43/90 //(C07D487/04,249:00,239:00)

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 02/088127 A (BAYER) 7. November 2002 (2002-11-07) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,3	1,13
A	WO 02/088126 A (BAYER) 7. November 2002 (2002-11-07) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,3	1,13

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&amp;" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

26. April 2004

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

04/05/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Alfaro Faus, I

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

PCT/EP 02/12774

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 02088127	A	07-11-2002	DE	10121102 A1	07-11-2002
			WO	02088127 A2	07-11-2002
			EP	1392695 A2	03-03-2004
WO 02088126	A	07-11-2002	DE	10121162 A1	31-10-2002
			WO	02088126 A1	07-11-2002
			EP	1392693 A1	03-03-2004